



(19) 日本国特許庁

## 公開特許公報

特許願(2)(後記テテシ)

昭和48年1月24日

特許庁長官 三宅幸夫 殿

## 1. 発明の名称

新規なチアゾロベンズイミダゾール誘導体の製造法

## 2. 発明者

住所 大分県中津市大学島田学園町455-3

氏名 飯谷智光

(以下略)

## 3. 特許出願人

住所 大阪市東区平野町3丁目35番地

名称 吉富製薬株式会社  
(672)  
代表者 不破泰

## 4. 代理人

平541  
住所 大阪市東区平野町3丁目35番地

吉富製薬株式会社内

氏名 弁理士(6630)高宮城勝

## 5. 添付書類の目録

(1) 明細書 1通  
(2) 委任状 1通  
(3) 特許願副本 1通

⑪特開昭 49 - 95997

⑬公開日 昭49.(1974) 9.11

⑭特願昭 48-10463

⑮出願日 昭48.(1973)1.24

審査請求 未請求 (全4頁)

府内整理番号

6736 44

6647 49

7167 49

⑯日本分類

16 E621

30 F371.222

30 F932

## 明細書

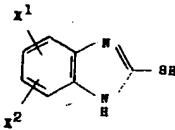
## 1. 発明の名称

新規なチアゾロベンズイミダゾール誘導体の製

造法

## 2. 特許請求の範囲

一般式



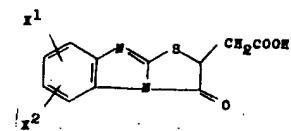
で表わされる2-メルカブトベンズイミダゾール

化合物と一般式



で表わされる酸無水物を反応させることを特徴と

する一般式



で表わされるチアゾロベンズイミダゾール誘導体

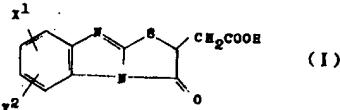
の製造法。

上記式中  $X^1$ ,  $X^2$  はそれぞれ水素、ハロゲン、低級アルキルまたは低級アルコキシを示し、 $R$  は-CH=CH-または-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-を示し、ここで  $X$ 

は活性基である。

## 1. 発明の詳細な説明

本発明は一般式

〔式中  $X^1$ ,  $X^2$  はそれぞれ水素、ハロゲン(フ

ッケン、塩素、臭素、ヨウ素)、低級アルキル(メ

チル、エチルなど)または低級アルコキシ(メト

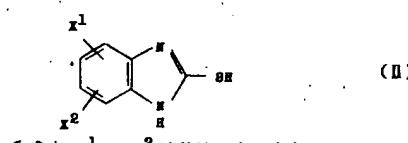
キシ、エトキシなど)を示す。〕

で表わされる新規なチアゾロベンズイミダゾール

誘導体の製造法に関する。

本発明方録によれば、一般式(I)の化合物は、

一般式



[式中  $X^1$ ,  $X^2$  は前述のとおり]

で表わされる 2-メルカブトベンズイミダゾール

化合物と一般式



[式中  $\Delta$  は  $-\text{CH}=\text{CH}-$  または  $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$  を示し、

ここで  $\Delta$  はハロゲン、メチルスルホニルオキシ、

ドーテリルスルホニルオキシなどの活性基を示す。]

で表わされる酸無水物を反応させることにより製造される。

反応は無溶媒あるいは不活性溶媒（ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレ

特開昭49-95997(2)  
ングリコールジメチルエーテル、ジエチレングリ

コールジメチルエーテル等のエーテル類、ジメチ

ルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、ヘキサ

メチルホスホロアミド等のアミド類、アセトン、

メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、

シクロヘキサン等のケトン類、酢酸エチル、酢

酸ブチル等のエステル類、ギ酸、酢酸、脂肪酸等の

カルボン酸類、リン酸、ポリリン酸、ベンゼン、

トルエン、キシレン、クメン、リグロイン等の炭

化水素類、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロル

エタン等のハロゲン化炭化水素類等またはこれら

の混合溶媒）中で行なわれる。

反応に際しては、ナトリウムメチラート、カリウ

ムエチラート、カ性ソーダ、カ性カリ、炭酸カリ、

炭酸ソーダ、重炭酸カリ、重炭酸ソーダ、重炭酸

カルシウム、トリエチルアミン、ピリジン、キノ

リン、ヨーメチルモルホリン等の脱酸剤を用いて

もよく、またメルカブトベンズイミダゾールをあ

らかじめ金属塩（ソーダ塩、カリウム塩、リチ

ウム塩、銀塩、銅塩等）として、反応に供してもよ

い。反応温度は室温から150度付近で、反応時

間は数時間から数十時間程度である。

得られる化合物は必要に応じて、ナトリウム、カ

リウム、銀、銅、カルシウム、バリウム、トリエ

チルアミン、ピリジン、キノリン等との有機塩、

無機塩として単離精製しても良い。

かくして得られる化合物(I)は植物生長調節作用を有し、農薬として有用である。

以下に実施例を示して、本発明を具体的に説明

するが、本発明はこれらのみに限定されるものではない。

#### 実施例 1

#### 2-カルボキシメチル-3-オキソ-2,3-

#### ジヒドロチアゾロ[3,2- $\alpha$ ]ベンズイミダ

#### ゾールの製造

##### 方法 1

2-メルカブトベンズイミダゾール3.0g、無

水マレイン酸19.6gをジオキサン100mlに加

え、24時間還流した。反応液を室温に冷却する

と、黄色結晶28.0gを得た。溶液を水1lに注

ぐと、さらに11.0gの結晶を得た。両結晶を合

せ、醇酸より再結晶すると、融点207~209

℃(分解)〔淡褐色の固体に変化〕を示す表題化

合物29.1gを黄色結晶性粉末として得た。

##### 方法 2

2-メルカブトベンズイミダゾール1.00gを

ジメチルホルムアミド200mlに溶解し、かくは

ん下に、無水マレイン酸6gを含むジメチルホ

ルムアミド溶液 10 ml を 2 時間を掛して滴下し、  
40 時間かくはんした。淡褐色透明の反応液を攪  
拌し、得られた褐色結晶を静臥より分別結晶する  
と、原料 2-メルカブトベンズイミダゾール 1.0  
g と表題化合物 2.2 g を得た。

方法 1

2-メルカブトベンズイミダゾール 1.0 g、2  
-ブロモコハク酸無水物 3.6 g、炭酸カリ 2.9 g  
をジオキサン 100 ml に加え、60 時間かくはん  
通流した。熱時不溶物を尹弃し、溶液を室温まで  
冷却した後、水 1 L に注ぎ、析出する結晶を静臥  
から再結晶すると、表題化合物 1.6 g を得た。

方法 4

2-メルカブトベンズイミダゾール 1.0 g、無  
水マレイン酸 1.0 g をよく混和し、封管中で 12  
0 ~ 140 °C に 6 時間保つた。得られた固型物を

特開 昭49-95997(3)  
醇酸から再結晶すると、表題化合物 1.3 g を得た。

前記実施例と同様な方法により、次の化合物が  
製造される。

◎ 2-カルボキシメチル-6-(または 7-)

クロロ-3-オキソ-2,3-ジヒドロチアゾ  
ロ[3,2-a]ベンズイミダゾール、融点 17  
6 ~ 178 °C (分解)

◎ 2-カルボキシメチル-6,7-ジメトキシ  
-3-オキソ-2,3-ジヒドロチアゾロ[3  
,2-a]ベンズイミダゾール、融点 220 °C 以  
上

◎ 2-カルボキシメチル-6-(または 7-)

メチル-3-オキソ-2,3-ジヒドロチアゾ  
ロ[3,2-a]ベンズイミダゾール、

代理人弁理士 高宮城 勝

6. 前記以外の発明者

住所 大分県中津市 1345 (無町名)

氏名 小谷萌音

手 続 補 正 書

昭和 48 年 4 月 18 日

特許庁長官三宅幸夫 殿

1. 事件の表示

昭和 48 年特許願第 10463 号

2. 発明の名称

新規なチアゾロベンズイミダゾール誘導体の製造法

3. 補正をする者

事件との関係	特許出願人
住 所	大阪市東区平野町 3 丁目 35 番地
名 称	吉富製薬株式会社
(6 7 2)	代表者 不破泰

4. 代 理 人

住 所	大阪市東区平野町 3 丁目 35 番地
名 称	吉富製薬株式会社内
氏 名	弁理士 高宮城勝 (6 6 3 0)

5. 補正の対象

明細書の発明の詳細な説明の欄

6. 補正の内容

特開 昭49-95997(4)

- 明細書第8頁14行目の「ベンズイミダゾール」
- 「」の後に「融点173～175℃(分解)」を  
挿入する。

以 上